

P C T

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
〔PCT36条及びPCT規則70〕

REC'D 22 JUL 2004

WIPO

PCT

出願人又は代理人 の書類記号 1488	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知（様式PCT/ IPEA/416）を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/07200	国際出願日 (日.月.年) 06.06.2003	優先日 (日.月.年) 07.06.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ⁷ C07D471/04, A61K31/519, A61K31/5377, A61K31/55, A61P3/10, A61P11/02, A61P11/06, A61P13/10, A61P17/00, A61P17/04, A61P17/06, A61P19/02, A61P25/04, A61P27/14, A61P29/00, A61P31/10,		
出願人 (氏名又は名称) 協和醗酵工業株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 6 ページからなる。
- ☐ この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。
(PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照)
この附属書類は、全部で _____ ページである。
3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。
- I ☒ 国際予備審査報告の基礎
 - II ☐ 優先権
 - III ☒ 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
 - IV ☒ 発明の単一性の欠如
 - V ☒ PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
 - VI ☐ ある種の引用文献
 - VII ☐ 国際出願の不備
 - VIII ☐ 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 25.12.2003	国際予備審査報告を作成した日 28.06.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員)	4C 8619
	関係 電話番号 03-3581-1101 内線 3452	

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
 PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- | | | |
|-------------------------------------|----------------|----------------------|
| <input type="checkbox"/> 明細書 | 第 _____ ページ、 | 出願時に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書 | 第 _____ ページ、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書 | 第 _____ ページ、 | 付の書簡と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲 | 第 _____ 項、 | 出願時に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲 | 第 _____ 項、 | PCT19条の規定に基づき補正されたもの |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲 | 第 _____ 項、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲 | 第 _____ 項、 | 付の書簡と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 図面 | 第 _____ ページ/図、 | 出願時に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 図面 | 第 _____ ページ/図、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 図面 | 第 _____ ページ/図、 | 付の書簡と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 _____ ページ、 | 出願時に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 _____ ページ、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 _____ ページ、 | 付の書簡と共に提出されたもの |

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

Ⅲ. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 39-43

理由：

☒ この国際出願又は請求の範囲 39-43 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

人の身体の治療による処置方法に関するものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 39-43 について、国際調査報告が作成されていない。

2. ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を満たしていないので、有効な国際予備審査をすることができない。

☐ 書面による配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

☐ 磁気ディスクによる配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

IV. 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

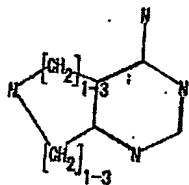
- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☒ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☐ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲1にマーカッシュ形式で記載された化合物群は、



という共通の化学構造を有するものと認められるものの、斯かる構造を有する化合物は、Registry Number (以下、RN) 68639-14-5、RN32160-91-1、RN23935-87-7、RN24051-08-9等公知であるから、その化学構造が重要な化学構造要素であることができない。そして、これらの一群の発明の間には、PCT規則13.2の第2文の意味において特別な技術的特徴と考えられる他の共通の事項は存在しない。したがって、これらの一群の発明は単一の一般的発明概念を形成するように連関しているとは認められない。

請求の範囲1にマーカッシュ形式で記載された化合物群は、マーカッシュ形式の一般式での変数部分の R^2 の構造[(i)～(iv)]、及び同じく変数部分である R^3 とAとの組み合わせ[(a)、(b)]に着目して、

- (1) R^2 が(i)で、 R^3 とAとが(a)の場合の化合物群、
- (2) R^2 が(i)で、 R^3 とAとが(b)の場合の化合物群、
- (3) R^2 が(ii)で、 R^3 とAとが(a)の場合の化合物群、
- (4) R^2 が(ii)で、 R^3 とAとが(b)の場合の化合物群、
- (5) R^2 が(iii)で、 R^3 とAとが(a)の場合の化合物群、
- (6) R^2 が(iii)で、 R^3 とAとが(b)の場合の化合物群、
- (7) R^2 が(iv)で、 R^3 とAとが(a)の場合の化合物群、
- (8) R^2 が(iv)で、 R^3 とAとが(b)の場合の化合物群

の8の発明群を構成するものと認める。請求項2～請求項43に記載の発明は、請求項1を引用するものであり、上記(1)～(8)の化合物群に対応する発明群を構成するものである。

4. したがって、この国際予備審査報告書を作成するに際して、国際出願の次の部分を、国際予備審査の対象にした。

- ☐ すべての部分
- ☒ 請求の範囲 第1～38項における、請求の範囲第1項の一般式で R^1 が(i)、 R^3 とAとが(a)の場合の化合物群 に関する部分

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)	請求の範囲	1-38	有
	請求の範囲		無
進歩性(IS)	請求の範囲	1-38	有
	請求の範囲		無
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲	1-38	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1: WO 01/29000 A2 (DU PONT PHARMACEUTICALS COMPANY) 2001.04.26
文献2: WO 02/22604 A1 (VERTEX PHARMACEUTICALS, INC.) 2002.03.21
文献3: WO 02/22602 A2 (VERTEX PHARMACEUTICALS, INC.) 2002.03.21

*請求の範囲: 1-38

請求の範囲第1項~第38項に記載の発明は、国際調査報告で引用した文献1~3に対して、新規性、進歩性を有する。

文献1~3には、本国際出願の請求の範囲第1項の一般式(I)で R^2 が(i)で R^3 とAが(a)の化合物は、記載されていないし示唆もされていない。また、そのような化合物が、抗炎症作用を有することやTARC(CCL17)及び/またはMDC(CCL22)の関与する疾患に有効なことは、記載されていないし示唆もされていない。

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 欄の続き

国際特許分類 (I P C) の続き

Int. Cl⁷ A61P31/14, A61P35/00, A61P35/02, A61P37/02, A61P37/06, A61P37/08,
A61P43/00, C07D487/04

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/JP2003/007200



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 1488	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/JP2003/007200	International filing date (<i>day/month/year</i>) 06 June 2003 (06.06.2003)	Priority date (<i>day/month/year</i>) 07 June 2002 (07.06.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 471/04, A61K 31/519, 31/5377, 31/55, A61P 3/10, 11/02, 11/06, 13/10, 17/00, 17/04, 17/06, 19/02, 25/04, 27/14, 29/00, 31/10, (see supplemental sheet)		
Applicant KYOWA HAKKO KOGYO CO., LTD.		

<p>1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>6</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p><input type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).</p> <p>These annexes consist of a total of <u> </u> sheets.</p>	
<p>3. This report contains indications relating to the following items:</p> <p>I <input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report</p> <p>II <input type="checkbox"/> Priority</p> <p>III <input checked="" type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</p> <p>IV <input checked="" type="checkbox"/> Lack of unity of invention</p> <p>V <input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</p> <p>VI <input type="checkbox"/> Certain documents cited</p> <p>VII <input type="checkbox"/> Certain defects in the international application</p> <p>VIII <input type="checkbox"/> Certain observations on the international application</p>	

Date of submission of the demand 25 December 2003 (25.12.2003)	Date of completion of this report 28 June 2004 (28.06.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP2003/007200

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☐ the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the claims:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item.

These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP03/07200

III. Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

1. The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

☐ the entire international application.

☒ claims Nos. 39-43

because:

☒ the said international application, or the said claims Nos. 39-43
relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

Relates to a method for treating the human body.

☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. _____
are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ the claims, or said claims Nos. _____ are so inadequately supported
by the description that no meaningful opinion could be formed.

☒ no international search report has been established for said claims Nos. 39-43

2. A meaningful international preliminary examination cannot be carried out due to the failure of the nucleotide and/or amino acid sequence listing to comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions:

☐ the written form has not been furnished or does not comply with the standard.

☐ the computer readable form has not been furnished or does not comply with the standard.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP03/07200

IV. Lack of unity of invention

1. In response to the invitation to restrict or pay additional fees the applicant has:

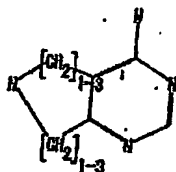
- ☐ restricted the claims.
- ☐ paid additional fees.
- ☐ paid additional fees under protest.
- ☒ neither restricted nor paid additional fees.

2. ☐ This Authority found that the requirement of unity of invention is not complied with and chose, according to Rule 68.1, not to invite the applicant to restrict or pay additional fees.

3. This Authority considers that the requirement of unity of invention in accordance with Rules 13.1, 13.2 and 13.3 is

- ☐ complied with.
- ☒ not complied with for the following reasons:

The group of compounds described in Markush format in Claim 1 is found to have the following common structure:



However, the compounds with such a structure are known to have Registry Numbers (referred to as RN hereinbelow) including 68639-14-5, RN 32160-91-1, RN 23935-87-7, and RN 24051-08-9. Therefore, the chemical structure thereof cannot be considered as an important chemical structural element. Further, there is no other common feature that can be considered a special technological feature in the sense of PCT Rule 13.2, second sentence, between the inventions of this group. Therefore, the inventions of this group cannot be considered to be so linked as to form a single general concept.

The group of compounds described in Markush format in Claim 1 can be considered to constitute the following eight groups of inventions, if attention is focused on the structure [(i)-(iv)] of R^2 , which is a variable component in the general formula in the Markush format, and the combinations [(a), (b)] of R^3 and A, which are also the variable components:

- (1) A group of compounds such that R^2 is (i) and R^3 and A constitute (a).
- (2) A group of compounds such that R^2 is (i) and R^3 and A constitute (b).
- (3) A group of compounds such that R^2 is (ii) and R^3 and A constitute (a).
- (4) A group of compounds such that R^2 is (ii) and R^3 and A constitute (b).
- (5) A group of compounds such that R^2 is (iii) and R^3 and A constitute (a).
- (6) A group of compounds such that R^2 is (iii) and R^3 and A constitute (b).
- (7) A group of compounds such that R^2 is (iv) and R^3 and A constitute (a).
- (8) A group of compounds such that R^2 is (iv) and R^3 and A constitute (b).

The inventions described in claims 2 to 43 cite claim 1 and constitute a group of inventions corresponding to a group of compounds (1) to (8).

4. Consequently, the following parts of the international application were the subject of international preliminary examination in establishing this report:

- ☐ all parts.
- ☒ the parts relating to claims Nos. 1-38 that pertain to a group of chemicals in which in the General Formula of claim 1, R^2 is (i) and R^3 and A are (a).

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP03/07200

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-38	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-38	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-38	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

Document 1: WO 01/29000, A2 (DU PONT PHARMACEUTICALS CO.), 26 April, 2001.
 Document 2: WO 01/22604, A1 (DU PONT PHARMACEUTICALS CO.), 21 March, 2002.
 Document 3: WO 01/22602, A2 (DU PONT PHARMACEUTICALS CO.), 21 March, 2002.

Claims 1-38

The inventions of claims 1-38 appear to possess novelty and involve an inventive step with respect to documents 1-3 cited in the ISR.

Documents 1-3 neither describe nor suggest the compounds in which R^2 is (i) and R^3 and A constitute (a) in the general formula (I) of claim 1 of the present international application. Furthermore, such compounds are neither described nor suggested as having an anti-inflammatory effect or being effective against diseases associated with TARC (CCL17) and/or MDC (CCL22).

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/JP03/07200

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of Box :

Continuation of International Patent Classification (IPC)

Int. Cl⁷ A61P31/14, A61P35/00, A61P35/02, A61P37/02, A61P37/06, A61P37/08, A61P43/00,
C07D487/04